

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
8. November 2001 (08.11.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/82858 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 403/10,
A61K 31/4174, A61P 43/00

Bernhard [DE/DE]; Carl-Neuberg-Str. 1, 30625 Hannover (DE). SCHMIDT, Boris [DE/DE]; Rebgasche 3b, 79639 Grenzach-Wyhlen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/05043

(74) Anwälte: MEYERS, Hans-Wilhelm usw.; Postfach 10 22 41, 50462 Köln (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:

4. Mai 2001 (04.05.2001)

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

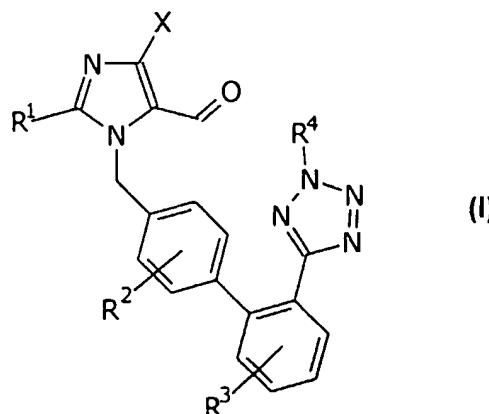
Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: NOVEL COMPOUNDS FOR THE TREATMENT OF INFLAMMATORY AND CARDIOVASCULAR DISEASES

(54) Bezeichnung: NEUE VERBINDUNGEN ZUR BEHANDLUNG INFLAMMATORISCHER UND KARDIOVASKULÄRER ERKRANKUNGEN



WO 01/82858 A3

Acylgruppen insbesondere Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, iso-Butyl-, tert.-Butyl darstellt. Halogen oder -OH ist, R³ = H, substituierte oder unsubstituierte Alkyl- oder Acylgruppen insbesondere Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, iso-Butyl-, tert.-Butyl darstellt. Halogen oder -OH ist, R⁴ = H, substituierte oder unsubstituierte Alkyl- oder Acylgruppen insbesondere Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, iso-Butyl-, tert.-Butyl darstellt oder ein Metallrest, insbesondere Alkalikation ist.

(57) Abstract: The invention concerns a compound having structural formula (I), wherein R¹ represents H, substituted or unsubstituted alkyl or acyl groups, especially methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, tert. Butyl; X = halogen or OH; R² represents H, substituted or unsubstituted alkyl or acyl groups, especially methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, tert. butyl, halogen or OH; R³ represents H, substituted or unsubstituted alkyl or acyl groups, especially methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, tert. butyl, halogen or OH; R⁴ represents H, substituted or unsubstituted alkyl or acyl groups, especially methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, tert. butyl or is a metal radical, especially an alkali cation.

(57) Zusammenfassung: Verbindung mit der Strukturformel (I) wobei R¹ = H, substituierte oder unsubstituierte Alkyl- oder Acylgruppen insbesondere Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, iso-Butyl-, tert.-Butyl darstellt. Halogen oder -OH ist, R³ = H, substituierte oder unsubstituierte Alkyl- oder Acylgruppen insbesondere Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, iso-Butyl-, tert.-Butyl darstellt. Halogen oder -OH ist, R⁴ = H, substituierte oder unsubstituierte Alkyl- oder Acylgruppen insbesondere Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, iso-Butyl-, tert.-Butyl darstellt oder ein Metallrest, insbesondere Alkalikation ist.



(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts: 27. Juni 2002

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.*

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

In' stational Application No
PCT/EP 01/05043

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D403/10 A61K31/4174 A61P43/00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07D A61K A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 5 138 069 A (DAVID J. CARINI ET AL.) 11 August 1992 (1992-08-11) cited in the application column 139-140, example 114 ; column 155-156, example 140 E ; column 157-158, example 140K ---	1,7
X	WO 92 20342 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 26 November 1992 (1992-11-26) the whole document ---	1,10
A	EP 0 581 003 A (BAYER AG) 2 February 1994 (1994-02-02) page 10, line 50 - line 58; claims; examples 16,17 ---	1,10 -/-

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- 'T' later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- 'X' document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- 'Y' document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- '&' document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

2 April 2002

Date of mailing of the international search report

11/04/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Van Bijlen, H

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 01/05043

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 92 00977 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 23 January 1992 (1992-01-23) claims -----	1,10

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/05043

Patent document cited in search report	Publication date		Patent family member(s)	Publication date	
US 5138069	A 11-08-1992		AT 113276 T AU 599396 B2 AU 7559687 A CA 1334092 A1 CY 1855 A DE 3750687 D1 DE 3750687 T2 DK 359687 A EP 0253310 A2 ES 2063734 T3 FI 873071 A ,B, HK 55495 A HU 45976 A2 HU 218461 B IE 69984 B1 IL 83153 A KR 9005020 B1 KR 9005045 B1 LU 88662 A9 LV 5486 A3 NO 176049 B PT 85312 A ,B SU 1694062 A3 US 5128355 A US 5153197 A US 5155118 A AT 151755 T AT 164520 T AU 2777189 A CA 1338238 A1 DE 68927965 D1 DE 68927965 T2 DE 68928631 D1 DE 68928631 T2 DK 5189 A EP 0324377 A2 EP 0733366 A2 ES 2100150 T3 ES 2117463 T3 FI 890070 A ,B, GR 3024053 T3 HU 9500636 A3 IE 960772 L JP 2795746 B2 JP 3501020 T JP 7025738 B KR 9107213 B1 LU 90266 A9 MD 28 B1 NO 177265 B	15-11-1994 19-07-1990 21-01-1988 24-01-1995 05-04-1996 01-12-1994 23-02-1995 12-01-1988 20-01-1988 16-01-1995 12-01-1988 21-04-1995 28-09-1988 28-08-2000 16-10-1996 15-12-1991 18-07-1990 18-07-1990 01-12-1995 10-03-1994 17-10-1994 01-08-1987 23-11-1991 07-07-1992 06-10-1992 13-10-1992 15-05-1997 15-04-1998 13-07-1989 09-04-1996 22-05-1997 24-07-1997 07-05-1998 22-10-1998 08-07-1989 19-07-1989 25-09-1996 16-06-1997 01-08-1998 08-07-1989 31-10-1997 28-11-1995 07-07-1989 10-09-1998 07-03-1991 22-03-1995 20-09-1991 01-10-1998 30-06-1994 08-05-1995	
WO 9220342	A 26-11-1992		AU 664375 B2 AU 2026992 A CA 2103276 A1 CZ 9302351 A3 EP 0584250 A1 IE 921534 A1 IL 101858 A	16-11-1995 30-12-1992 16-11-1992 16-03-1994 02-03-1994 18-11-1992 04-08-1996	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Int'l Application No

PCT/EP 01/05043

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9220342	A	JP 2930252 B2 JP 6508128 T KR 222627 B1 MX 9202243 A1 NZ 242724 A WO 9220342 A1 US 5492904 A ZA 9203557 A	03-08-1999 14-09-1994 01-10-1999 01-11-1992 27-09-1994 26-11-1992 20-02-1996 15-11-1993
EP 581003	A 02-02-1994	DE 4221009 A1 AT 196136 T AU 4146393 A CA 2099078 A1 CN 1082538 A ,B CN 1182734 A CZ 9301173 A3 DE 59310098 D1 EP 0581003 A1 ES 2151891 T3 FI 932952 A HU 64753 A2 IL 106107 A JP 6073016 A MX 9303599 A1 NO 932133 A NZ 247974 A NZ 272784 A RU 2110514 C1 SK 66893 A3 US 5508299 A ZA 9304583 A	05-01-1994 15-09-2000 06-01-1994 27-12-1993 23-02-1994 27-05-1998 19-01-1994 12-10-2000 02-02-1994 16-01-2001 27-12-1993 28-02-1994 30-09-1997 15-03-1994 31-01-1994 27-12-1993 26-07-1996 26-07-1996 10-05-1998 02-02-1994 16-04-1996 02-02-1994
WO 9200977	A 23-01-1992	US 5137902 A AT 121087 T AU 639400 B2 AU 8311691 A BG 61341 B1 BG 97438 A CZ 9203912 A3 CZ 280018 B6 DE 69108913 D1 DE 69108913 T2 DK 539509 T3 EP 0539509 A1 ES 2071325 T3 FI 930109 A HU 63411 A2 IE 912438 A1 IL 98794 A JP 2550455 B2 JP 5508415 T KR 162669 B1 NO 303015 B1 NZ 238920 A PL 168311 B1 RO 111270 B1 SK 391292 A3 WO 9200977 A2	11-08-1992 15-04-1995 22-07-1993 04-02-1992 30-06-1997 24-03-1994 15-12-1993 13-09-1995 18-05-1995 24-08-1995 03-07-1995 05-05-1993 16-06-1995 12-01-1993 30-08-1993 15-01-1992 27-11-1995 06-11-1996 25-11-1993 01-12-1998 18-05-1998 27-07-1993 29-02-1996 30-08-1996 07-07-1993 23-01-1992

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/05043

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9200977	A	ZA 9105457 A	31-03-1993

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

In'ationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05043

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D403/10 A61K31/4174 A61P43/00

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüftoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D A61K A61P

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüftoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	US 5 138 069 A (DAVID J. CARINI ET AL.) 11. August 1992 (1992-08-11) in der Anmeldung erwähnt * Spalte 139-140, Beispiel 114; Spalte 155-156, Beispiel 140E; Spalte 157-158, Beispiel 140K *	1,7
X	WO 92 20342 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 26. November 1992 (1992-11-26) * das ganze Dokument *	1,10
A	EP 0 581 003 A (BAYER AG) 2. Februar 1994 (1994-02-02) Seite 10, Zeile 50 - Zeile 58; Ansprüche; Beispiele 16,17	1,10

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

g Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

2. April 2002

11/04/2002

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Van Bijlen, H

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05043

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 92 00977 A (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 23. Januar 1992 (1992-01-23) Ansprüche -----	1,10

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05043

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	
US 5138069	A 11-08-1992	AT 113276 T AU 599396 B2 AU 7559687 A CA 1334092 A1 CY 1855 A DE 3750687 D1 DE 3750687 T2 DK 359687 A EP 0253310 A2 ES 2063734 T3 FI 873071 A ,B, HK 55495 A HU 45976 A2 HU 218461 B IE 69984 B1 IL 83153 A KR 9005020 B1 KR 9005045 B1 LU 88662 A9 LV 5486 A3 NO 176049 B PT 85312 A ,B SU 1694062 A3 US 5128355 A US 5153197 A US 5155118 A AT 151755 T AT 164520 T AU 2777189 A CA 1338238 A1 DE 68927965 D1 DE 68927965 T2 DE 68928631 D1 DE 68928631 T2 DK 5189 A EP 0324377 A2 EP 0733366 A2 ES 2100150 T3 ES 2117463 T3 FI 890070 A ,B, GR 3024053 T3 HU 9500636 A3 IE 960772 L JP 2795746 B2 JP 3501020 T JP 7025738 B KR 9107213 B1 LU 90266 A9 MD 28 B1 NO 177265 B	15-11-1994 19-07-1990 21-01-1988 24-01-1995 05-04-1996 01-12-1994 23-02-1995 12-01-1988 20-01-1988 16-01-1995 12-01-1988 21-04-1995 28-09-1988 28-08-2000 16-10-1996 15-12-1991 18-07-1990 18-07-1990 01-12-1995 10-03-1994 17-10-1994 01-08-1987 23-11-1991 07-07-1992 06-10-1992 13-10-1992 15-05-1997 15-04-1998 13-07-1989 09-04-1996 22-05-1997 24-07-1997 07-05-1998 22-10-1998 08-07-1989 19-07-1989 25-09-1996 16-06-1997 01-08-1998 08-07-1989 31-10-1997 28-11-1995 07-07-1989 10-09-1998 07-03-1991 22-03-1995 20-09-1991 01-10-1998 30-06-1994 08-05-1995	15-11-1995 30-12-1992 16-11-1992 16-03-1994 02-03-1994 18-11-1992 04-08-1996
WO 9220342	A 26-11-1992	AU 664375 B2 AU 2026992 A CA 2103276 A1 CZ 9302351 A3 EP 0584250 A1 IE 921534 A1 IL 101858 A	16-11-1995 30-12-1992 16-11-1992 16-03-1994 02-03-1994 18-11-1992 04-08-1996	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05043

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9220342	A		JP 2930252 B2 JP 6508128 T KR 222627 B1 MX 9202243 A1 NZ 242724 A WO 9220342 A1 US 5492904 A ZA 9203557 A	03-08-1999 14-09-1994 01-10-1999 01-11-1992 27-09-1994 26-11-1992 20-02-1996 15-11-1993
EP 581003	A	02-02-1994	DE 4221009 A1 AT 196136 T AU 4146393 A CA 2099078 A1 CN 1082538 A , B CN 1182734 A CZ 9301173 A3 DE 59310098 D1 EP 0581003 A1 ES 2151891 T3 FI 932952 A HU 64753 A2 IL 106107 A JP 6073016 A MX 9303599 A1 NO 932133 A NZ 247974 A NZ 272784 A RU 2110514 C1 SK 66893 A3 US 5508299 A ZA 9304583 A	05-01-1994 15-09-2000 06-01-1994 27-12-1993 23-02-1994 27-05-1998 19-01-1994 12-10-2000 02-02-1994 16-01-2001 27-12-1993 28-02-1994 30-09-1997 15-03-1994 31-01-1994 27-12-1993 26-07-1996 26-07-1996 10-05-1998 02-02-1994 16-04-1996 02-02-1994
WO 9200977	A	23-01-1992	US 5137902 A AT 121087 T AU 639400 B2 AU 8311691 A BG 61341 B1 BG 97438 A CZ 9203912 A3 CZ 280018 B6 DE 69108913 D1 DE 69108913 T2 DK 539509 T3 EP 0539509 A1 ES 2071325 T3 FI 930109 A HU 63411 A2 IE 912438 A1 IL 98794 A JP 2550455 B2 JP 5508415 T KR 162669 B1 NO 303015 B1 NZ 238920 A PL 168311 B1 RO 111270 B1 SK 391292 A3 WO 9200977 A2	11-08-1992 15-04-1995 22-07-1993 04-02-1992 30-06-1997 24-03-1994 15-12-1993 13-09-1995 18-05-1995 24-08-1995 03-07-1995 05-05-1993 16-06-1995 12-01-1993 30-08-1993 15-01-1992 27-11-1995 06-11-1996 25-11-1993 01-12-1998 18-05-1998 27-07-1993 29-02-1996 30-08-1996 07-07-1993 23-01-1992

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/05043

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9200977	A	ZA 9105457 A	31-03-1993